

19 BUNDESREPUBLIK  
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES  
PATENTAMT

12 Übersetzung der  
europäischen Patentschrift

51 Int. Cl.<sup>8</sup>:  
A 61 K 7/48

87 EP 0 534 286 B1

10 DE 38 54 275 T 2

21 Deutsches Aktenzeichen: 38 54 275.7  
86 Europäisches Aktenzeichen: 92 115 766.5  
86 Europäischer Anmeldetag: 2. 3. 88  
87 Erstveröffentlichung durch das EPA: 31. 3. 93  
87 Veröffentlichungstag  
der Patenterteilung beim EPA: 2. 8. 95  
47 Veröffentlichungstag im Patentblatt: 11. 4. 96

30 Unionspriorität: 32 33 31

06.03.87 JP 51276/87	09.03.87 JP 53769/87
16.03.87 JP 60718/87	11.03.87 JP 56049/87
16.03.87 JP 60719/87	02.06.87 JP 138727/87
28.05.87 JP 132054/87	30.06.87 JP 163682/87
30.06.87 JP 163683/87	30.06.87 JP 163685/87

73 Patentinhaber:

Kao Corp., Tokio/Tokyo, JP

74 Vertreter:

Wächtershäuser, G., Dipl.-Chem. Dr.rer.nat.,  
Pat.-Anw., 80331 München

84 Benannte Vertragsstaaten:

DE, ES, FR, GB, IT

72 Erfinder:

Yano, Shinji, Nakagun Wakayama, JP; Kawamata, Akira, Utsunomiya-shi, Tochigi, JP; Minematsu, Yoshihiro, Cinnacinnati OH 45249, US; Akazaki, Shuichi, Funabashi-shi, Chiba-ken, JP; Zama, Mitsuko, Yutaka-cho Shinagawa-ku, JP; Imokawa, Genji, Utsunomiya-shi, Tochigi-ken, JP; Takaishi, Naotake, Utsunomiya-shi, Tochigi-ken, JP; Ohtomo, Tsuyoshi, Funabashi-shi, Chiba-ken, JP; Komori, Takashi, Toshima-ku, Tokyo, JP

54 Äusserliches Hautpflegepräparat.

Anmerkung: Innerhalb von neun Monaten nach der Bekanntmachung des Hinweises auf die Erteilung des europäischen Patents kann jedermann beim Europäischen Patentamt gegen das erteilte europäische Patent Einspruch einlegen. Der Einspruch ist schriftlich einzureichen und zu begründen. Er gilt erst als eingelegt, wenn die Einspruchsgebühr entrichtet worden ist (Art. 99 (1) Europäisches Patentübereinkommen).

Die Übersetzung ist gemäß Artikel II § 3 Abs. 1 IntPatÜG 1991 vom Patentinhaber eingereicht worden. Sie wurde vom Deutschen Patentamt inhaltlich nicht geprüft.

DE 38 54 275 T 2

DE 38 54 275 T 2

Best Available Copy

92 115 766.5

Äußerliches HautpflegepräparatHintergrund der Erfindung1) Gebiet der Erfindung

Die Erfindung betrifft eine Zubereitung (Präparat) zur äußeren Hautpflege und insbesondere eine Zubereitung zur äußeren Hautpflege, die das Wasserrückhaltevermögen der Hornschicht erhöhen kann und die Haut in bezug auf die Rauigkeit verbessern kann.

2) Beschreibung des Standes der Technik

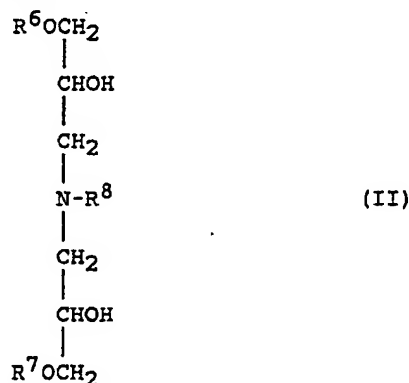
Der Wassergehalt der Hornschicht ist als ausschlaggebend zum Verleihen von Feuchtigkeit an die Haut und zum Aufrechterhalten der Hautglätte und -weichheit bekannt. Es wird berichtet, daß das Zurückhalten von Wasser auf einer wasserlöslichen Komponente beruht, die in der Hornschicht vorliegt, nämlich einer freien Aminosäure, organischen Säure, Harnstoff oder anorganischen Ionen. Diese Stoffe wurden entweder einzeln oder in Kombination in medizinische äußere Hautpflegezubereitungen oder kosmetische Zubereitungen im Hinblick auf Vermeiden von Hautrauhigkeit oder Verbessern der Haut eingemischt.

Daneben wurden auch viele Feuchthaltemittel mit hoher Wasseraffinität entwickelt und wurden für ähnliche Zwecke verwendet.

Diese Feuchthaltemittel verbleiben jedoch auf der Hautoberfläche, wenn sie auf die Haut aufgetragen werden, so daß sie als Wasserzufuhr für die Hornschicht dienen. Darüberhinaus sind ihre Wirkungen zeitweilig und sind nicht so ausgeprägt, daß sie das Wasserrückhaltevermögen der Hornschicht verbessern können und auch Hautrauhigkeit im wesentlichen heilen oder vermeiden können.

Zusammenfassung der Erfindung

Unter den vorstehenden Umständen führten die Autoren der vorliegenden Erfindung ausgedehnte Untersuchungen mit dem Ziel durch, die vorstehenden Aufgaben zu lösen. Im Ergebnis fand man, daß eine Verbindung, wiedergegeben durch die nachstehende allgemeine Formel (II) oder ein Salz davon, signifikante Wirkungen bei der Verbesserung des Wasserrückhaltevermögens der Hornschicht zeigt und daß die kombinierte Verwendung eines Tensids mit der Verbindung oder dem Salz die Wirkungen zusätzlich erhöhen kann, was zur Ausführung dieser Erfindung führte.

Allgemeine Formel (II):

worin  $R^6$  und  $R^7$  einzeln eine aliphatische Kohlenwasserstoffgruppe mit 10 bis 26 Kohlenstoffatomen bedeuten und  $R^8$  eine Gruppe  $-CH_2CH_2OH$ ,  $-CH_2COOH$  oder  $-COCH_3$  wiedergibt.

In einem Aspekt der Erfindung wird eine äußere Hautpflegezubereitung bereitgestellt, umfassend eine Verbindung, wiedergegeben durch die Formel (II) oder ein Salz davon und zusätzlich enthaltend ein Tensid.

Obwohl Einzelheiten des Wirkungsmechanismus der durch Formel (II) wiedergegebenen Verbindung oder eines Salzes davon in der erfindungsgemäßen äußeren Zubereitung zur Hautpflege noch nicht vollständig erkannt worden sind, scheint sie Lipidmembranen zwischen Hornzellen zu rekonstruieren, so daß die Hornschicht ihre wasserzurückhaltende Funktion aufweist.

Aufgrund des Einschlusses der Verbindung (II) oder eines Salzes davon mit einer solchen Wirkung kann die erfindungsgemäße äußere Zubereitung zur Hautpflege ausgezeichnete Wirkungen für die Verhinderung von Hautrauhigkeit und Verbesserung der Haut zeigen.

Die vorstehenden und weitere Aufgaben, Merkmale und Vorteile der vorliegenden Erfindung werden aus der nachstehenden Beschreibung und dem beigefügten Anspruch ersichtlich.

#### Beschreibung der Erfindung im einzelnen

Die Verbindungen der Formel (II), die bei der Ausführung dieser Erfindung geeignet sind, sind bereits bekannt. Jene, wiedergegeben durch die Formel (II), worin  $R^8$  eine Gruppe  $-CH_2CH_2OH$  oder  $-COCH_3$  bedeutet, können beispielsweise durch das Verfahren, beschrieben in Polish. J. Chem., 52, 1059 (1978), worauf vorstehend Bezug genommen wird, hergestellt werden. Andererseits kann die Verbindung der Formel (II), worin  $R^8$  eine Gruppe  $-CH_2COOH$  bedeutet, beispielsweise gemäß dem Verfahren des Ostdeutschen Patents Nr. 92940 (1973) hergestellt werden.

Als erläuternde Beispiele des in der Praxis dieser Erfindung verwendbaren Salzes der Verbindung (II) können jene erwähnt werden, die in kosmetischen Mitteln geeignet sind, wie Alkalimetallsalze.

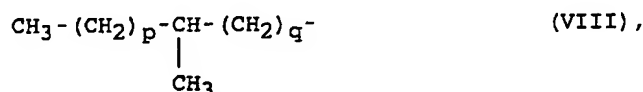
Keine besondere Einschränkung wird im Verhältnis der durch die Formel (II) wiedergegebenen Verbindung oder eines Salzes davon in der äußeren Hautpflegezubereitung auferlegt. Im Falle einer äußeren Zubereitung zur Hautpflege vom Emulsionstyp kann deren Verhältnis vorzugsweise 0,001 bis 50 Gew.-% (forthin einfach in "%" ausgedrückt), bevorzugter 0,1 bis 20 % der gesamten Zubereitung, betragen. Im Fall einer äußeren Zubereitung zur Hautpflege auf Ölbasis, die einen flüssigen Kohlenwasserstoff, wie Squalen, als Grundlage enthält, beträgt deren Verhältnis vorzugsweise 1 bis 50 %, bevorzugter 5 bis 25 %.

Als Tensid, das zum Einsatz in der äußeren Zubereitung zur Hautpflege geeignet ist, können beliebige nichtionische Tenside, anionische Tenside und amphotere Tenside genannt werden. Von diesen sind nichtionische Tenside besonders geeignet.

Beispielhaft für nichtionische Tenside, die erwähnt werden können, sind Polyoxyethylenalkylether, Polyoxyethylenalkylphenylether, Polyoxyethylenfettsäureester, Sorbitanfettsäureester, Polyoxyethylenorbitanfettsäureester, Fettsäuremonoglyceride, Glycerylether usw.. Unter diesen sind Glycerylether, wiedergegeben durch die nachstehende Formel (VII):



worin R eine Alkylgruppe mit 8 bis 24 Kohlenstoffatomen bedeutet, bevorzugt. Besonders bevorzugt sind Glycerylether der Formel (VII), worin R wiedergegeben wird durch die nachstehende Formel (VIII):



worin p eine ganze Zahl von 4 bis 10 bedeutet, q eine ganze Zahl von 5 bis 11 bedeutet und  $p + q$  11 bis 17 ist und verteilt ist mit einem Spitzenwert von  $p = 7$  und  $q = 8$ .

Das Verhältnis des Tensids kann 0,01 bis 20 % der gesamten Zubereitung betragen, wobei 0,1 bis 5 % besonders bevorzugt sind.

Erfindungsgemäße äußere Zubereitungen zur Hautpflege können grob in medizinische äußere Zubereitungen zur Hautpflege und kosmetische Zubereitungen gemäß ihrer Verwendungsweise klassifiziert werden.

Als beispielhafte medizinische äußere Zubereitungen zur Hautpflege können verschiedene Salben genannt werden, die einen oder mehrere medizinisch wirksame Bestandteile enthalten. Salben schließen sowohl jene, die eine Ölgrundlage als Grundlage, als auch jene, die eine Grundlage vom Öl/Wasser- oder Wasser/Öl-Emulsions-Typ als Grundlage aufweisen, ein. Keine besondere Beschränkung wird öligen Grundlagen auferlegt. Pflanzenöle, tierische Öle, synthetische Öle, Fettsäuren, natürliche und synthetische Glyceride usw. können beispielsweise erwähnt werden. Keine besondere Beschränkung wird medizinisch wirksamen Bestandteilen auferlegt. Beispielsweise können eines oder mehrere analgetische und antiphlogistische Mittel, antipruritische, desinfizierende, adstringierende Mittel, Erweichungsmittel, Hormone und dergleichen, falls erforderlich, geeigneterweise verwendet werden.

Beim Gebrauch als kosmetische Zubereitung ist es möglich, zusätzlich zu den wesentlichen Bestandteilen jene, die routinemäßig als kosmetische Bestandteile angewendet werden, zuzumischen, wie ölicher Stoff, Feuchthaltemittel, Ultraviolettlichtabsorptionsmittel, Alkohol, chelatbildendes Mittel, pH-Regulator, Antiseptikum, Verdickungsmittel, Pigment, Parfümgrundlage und dergleichen, auch als Kombinationen davon, falls erforderlich.

Als Kosmetika können die kosmetischen Zubereitungen in verschiedensten Formen formuliert werden, einschließlich beispielsweise Wasser/Öl- oder Öl/Wasser-Typ emulgierte Kosmetika, Cremes, kosmetische Emulsionen, Toilettenwasser, ölige Kosmetika, Lippenstifte, Grundlagen, Hautreinigungszubereitungen, Haartonika, Haarformzubereitungen, Haarpflegezubereitungen, Haarwuchsstimulantien usw..

Nach der allgemeinen Beschreibung der Erfindung kann ein besseres Verständnis durch Hinweis auf bestimmte spezielle Beispiele gewonnen werden, die hier lediglich zum Zweck der Erläuterung angegeben werden und nicht vorgesehen sind, einzuschränken, sofern nicht anders ausgewiesen.

#### Beispiele:

Die vorliegende Erfindung wird nachstehend durch die folgenden Bezugsbeispiele und Beispiele beschrieben.

#### Beispiel 1: (Bezugsbeispiel)

Übliche Verbindungen  $\Pi_1$  bis  $\Pi_{12}$  wurden getrennt verwendet. Gemische, jedes davon wurde durch Vermischen von Vaseline und Verbindung (II) in einem Gewichtsverhältnis 3:1 hergestellt und Vaseline (Vergleichsprodukt 1) wurden hinsichtlich Hautleitfähigkeit und Hautrauhigkeit durch die nachstehenden Verfahren bewertet. Die Ergebnisse sind in Tabelle 1 zusammengefaßt.

#### (Testverfahren)

Als freiwillige Probanden wurden im Winter 10 Frauen im Alter von 20 bis 50 Jahren ausgewählt, die Hautrauhigkeit an beiden Wangen aufwiesen. Unterschiedliche äußere Zubereitungen zur Hautpflege wurden getrennt auf die linke und rechte Wange jeder Probandin für 2 Wochen aufgetragen. Am folgenden Tag nach Abschluß des 2-wöchigen Auftragetests wurden Untersuchungen hinsichtlich nachstehender Eigenschaften ausgeführt.

#### (1) Hautleitfähigkeit:

Nach Waschen des Gesichts mit warmem Wasser von 37°C wurde jede Probandin für 20 Minuten in einem klimatisierten Raum bei 20°C und 40 % Luftfeuchtigkeit ruhen lassen. Der Wassergehalt ihrer Hornschicht wurde mit einem Hautleitfähigkeitsmeßgerät (hergestellt von IBS Company) gemessen. Ein geringerer Leitfähigkeitswert weist eine größere Hautrauhigkeit aus. Leitfähigkeitswerte von 5 oder geringer weisen starke Hautrauhigkeit aus. Im Gegensatz dazu wurde keine wesentliche Hautrauhigkeit beobachtet, wenn dieser Wert 20 oder höher war.

#### (2) Bewertung der Hautrauhigkeit:

Hautrauhigkeit wurde visuell bewertet und gemäß nachstehendem Standard eingestuft. Jede Bewertung wurde durch einen Durchschnittswert ausgewiesen.

Bewertung	Abstufung der Hautrauhigkeit
0	Keine Hautrauhigkeit wurde beobachtet.
1	Geringe Hautrauhigkeit wurde beobachtet.
2	Hautrauhigkeit wurde beobachtet.
3	Ziemlich starke Hautrauhigkeit wurde beobachtet.
4	Starke Hautrauhigkeit wurde beobachtet.

Tabelle 1

Verbindung Nr.	Formel (II)			Hautleit- fähig- keit	Bewertung der Haut- rauhigkeit
	R <sup>6</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>		
Erfin- dungs- gemä- ßes Pro- dukt (Be- zug)	II 1	n-C <sub>16</sub> H <sub>33</sub>	n-C <sub>16</sub> H <sub>33</sub>	18	1,0
	II 2	n-C <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	n-C <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	8	1,6
	II 3	n-C <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	n-C <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	11	1,4
	II 4	n-C <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	n-C <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	21	0,9
	II 5	n-C <sub>16</sub> H <sub>33</sub>	n-C <sub>16</sub> H <sub>33</sub>	17	1,0
	II 6	n-C <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	n-C <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	7	1,5
	II 7	n-C <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	n-C <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	10	1,3
	II 8	n-C <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	n-C <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	20	0,9
	II 9	n-C <sub>16</sub> H <sub>33</sub>	n-C <sub>16</sub> H <sub>33</sub>	17	1,1
	II 10	n-C <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	n-C <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	9	1,7
	II 11	n-C <sub>10</sub> H <sub>21</sub>	n-C <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	12	1,5
	II 12	n-C <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	n-C <sub>18</sub> H <sub>37</sub>	20	1,0
Vergleichsprodukt 1				6	2,8

**Beispiel 2:**

Unter getrennter Verwendung der in Beispiel 1 verwendeten Verbindungen wurden äußere Zubereitungen zur Hautpflege (emulgierte kosmetische Zubereitungen) von ihren entsprechenden Verbindungen, die in nachstehender Tabelle 2 dargestellt sind, formuliert. Ihre Wirkungen hinsichtlich Verbesserung der Haut in der Rauigkeit wurde in gleicher Weise wie in Beispiel 1 bewertet. Die Ergebnisse sind in Tabelle 3 dargestellt.

Tabelle 2

(Gew. -%)

Emulgierbare kosmetische Zubereitung	Erfindungsgemäßes Produkt				Vergleichsprodukt			
Zusammensetzung	2	3	4	2	3	4		
Glycerylether [in Formel (VII), R wird durch Formel (VIII) wieder- gegeben]	2,0	-	-	2,0	-	-	-	-
Argininmonocetylphosphat	-	2,0	-	-	2,0	-	-	-
Polyoxyethylen(20)sorbitanstearat	-	-	1,0	-	-	-	-	1,0
Sorbitanmonostearat	-	-	1,0	-	-	-	-	1,0
2-Octyldodecylmyristat	10,0	10,0	10,0	10,0	10,0	10,0	10,0	10,0
Vaseline	3,0	3,0	3,0	3,0	3,0	3,0	3,0	3,0
Squalan	5,0	5,0	5,0	5,0	5,0	5,0	5,0	5,0
Tocopherolacetat	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5	0,5
Verbindung (II)	1,0	1,0	1,0	1,0	-	-	-	-
Wasser	-----Ausgleich-----							



Tabelle 3

		Bewertung der Hautrauhigkeit		
		2	3	4
	Verbindung II <sub>1</sub>	0,1	0,3	0,8
	Verbindung II <sub>2</sub>	0,8	1,0	1,2
er-	Verbindung II <sub>3</sub>	0,5	0,8	1,1
fin-	Verbindung II <sub>4</sub>	0,1	0,3	0,7
dungs-	Verbindung II <sub>5</sub>	0,2	0,4	0,8
gemäs-	Verbindung II <sub>6</sub>	0,8	1,0	1,2
ses	Verbindung II <sub>7</sub>	0,5	0,8	1,1
Pro-	Verbindung II <sub>8</sub>	0,2	0,4	0,8
dukt	Verbindung II <sub>9</sub>	0,1	0,3	0,9
	Verbindung II <sub>10</sub>	0,8	1,1	1,2
	Verbindung II <sub>11</sub>	0,4	0,8	1,2
	Verbindung II <sub>12</sub>	0,2	0,4	0,8
	Vergleichsprodukt	2,1	2,5	2,6

## Beispiel 3: Kosmetische Emulsion

Eine kosmetische Emulsion wurde gemäß nachstehender Zusammensetzung formuliert. Die Komponenten der Wasserphase wurden bei 70°C gehalten, während sie unter Wärme vermischt wurden. Andererseits wurden die Komponenten der Ölphase erhitzt und bei 80°C vermischt. Nach Zugabe der vorstehend genannten Komponenten der Wasserphase unter allmählichem Rühren zu den Komponenten der Ölphase wurde das erhaltene Gemisch gleichförmig mit einem Homogenisator emulgiert. Nach der Emulgation wurde das Gemisch auf 30°C durch einen Wärmetauscher unter Bereitstellung der kosmetischen Emulsion abgekühlt.

Ölphasenkomponenten:	(Gew. -%)
Verbindung II <sub>1</sub>	1,0
mikrokristallines Wachs	0,5
Bienenwachs	2,0
Lanolin	1,5
flüssiges Paraffin	30,0
Sorbitansesquioleat	4,0
Polyoxyethylensorbitanmonooleat (20 EO)	1,0
Aluminiumstearat	0,2
Butylparaben	0,1
Wasserphasenkomponenten:	
Glycerin	8,0
Methylparaben	0,3
Parfümgrundlage	0,1
gereinigtes Wasser	Ausgleich

#### Beispiel 4: Reinigungscreme

Eine Reinigungscreme wurde gemäß der nachstehend beschriebenen Zusammensetzung formuliert. Komponenten der Ölphase wurden bei 80°C gehalten, während sie unter Wärme vermischt wurden. Die Komponenten der Wasserphase, die nebenher erwärmt und bei 70°C vermischt wurden, wurden zu den vorstehend genannten Komponenten der Ölphase gegeben und das erhaltene Gemisch wurde dann gleichförmig mit einem Homogenisator emulgiert. Nach der Emulgation wurde das Gemisch auf 30°C durch einen Wärmetauscher unter Bereitstellung der Reinigungscreme abgekühlt.

Ölphasenkomponente:	(Gew. -%)
Verbindung II <sub>1</sub>	3,0
Paraffin	2,0
Cetanol	1,0
Vaseline	18,5
flüssiges Paraffin	28,0
Glycerinmonostearatpolyoxyethylen- monolaurat (20 EO)	3,0
Wasserphasenkomponenten:	
Propylenglycol	3,0
Glycerin	2,0
Methylparaben	0,3
Parfümgrundlage	0,1
gereinigtes Wasser	Ausgleich

#### Beispiel 5: Toilettenwasser

Ein Toilettenwasser wurde gemäß der nachstehend beschriebenen Zusammensetzung formuliert. Glycerin und Propylenglycol wurden zu gereinigtem Wasser gegeben. Die ersten Komponenten wurden in dem letzteren bei Raumtemperatur unter Bereitstellung eines Anteils in gereinigtem Wasser gelöst. Andererseits wurden Erweichungsmittel und Tensid, Antiseptikum und Parfümgrundlage zu Ethanol gegeben und die ersten Komponenten wurden in dem letzteren bei Raumtemperatur gelöst. Die so gebildete Lösung wurde zu dem vorstehend genannten gereinigten Wasseranteil gegeben, um ersteren zu solubilisieren. Die erhaltene Lösung wurde in der Farbe mit einem Farbstoff modifiziert und unter Bereitstellung des Toilettenwassers filtriert.

	(Gew. -%)
Feuchthaltemittel: Glycerin	5,0
Propylenglycol	4,0
Erweichungsmittel: Verbindung II <sub>2</sub>	0,1
Tensid: Polyoxyethylen-hydriertes Rizinusöl (40 EO)	1,0
Ethanol	10,0
Antiseptikum: Methylparaben	0,2
gereinigtes Wasser	Ausgleich

### Beispiel 6: Lippenstift

Ein Lippenstift wurde gemäß der nachstehend beschriebenen Zusammensetzung hergestellt. Grundlagenmaterialien wurden erwärmt und geschmolzen und anschließend gleichförmig vermischt. Eine Farbe wurde zu der Schmelze gegeben. Nach Kneten des erhaltenen Gemisches und gleichförmigem Dispergieren wurde das Gemisch erneut geschmolzen und Parfümgrundlage zugegeben. Die Schmelze wurde entschäumt und in eine Form gegossen. Die Form wurde zur Verfestigung der Schmelze rasch abgekühlt. Der so verfestigte Stift wurde aus der Form genommen und in eine Ausgabevorrichtung gegeben. Nach Aufrichten wurde das äußere Aussehen des Stiftes außerdem geändert, indem er durch eine Flamme geführt wurde, wodurch seine Oberfläche gleichförmig unter Bereitstellung des Lippenstifts gestaltet wurde.

Grundlagenmaterialien:	(Gew.-%)
Verbindung II <sub>3</sub>	5,0
Rizinusöl	45,0
Hexadecylalkohol	23,0
Lanolin	4,0
Bienenwachs	5,0
Ozocerit	4,0
Candelillawachs	4,0
Carnaubawachs	2,0
Tocopherol	0,1
Butylparaben	0,1
 Färbemittel:	
Titanoxid	2,0
Red Color Nr. 202	0,5
Red Color Nr. 204	2,5
Red Color Nr. 227 (Al rake)	2,5
Orange Color Nr. 201	0,2
Parfümgrundlage	0,1

### Beispiel 7: Grundlage vom Emulsionstyp

Eine Grundlage vom Emulsionstyp wurde gemäß nachstehend beschriebener Zusammensetzung formuliert. Die Komponenten der Ölphase wurden vermischt, erwärmt und geschmolzen und bei 80°C gehalten. Andererseits wurden pulverförmige Bestandteile zugegeben und in den Komponenten der Wasserphase dispergiert. Die erhaltene Dispersion wurde auf 70°C erwärmt. Die vorstehend genannten Komponenten der Ölphase wurden zu den Wasserphasenkomponenten gegeben, gefolgt von Emulgation und Dispersion durch eine Emulgiervorrichtung. Eine so erhaltene Emulsion wurde auf 30°C mit einem Wärmetauscher unter Bereitstellung der Grundlage vom Emulsionstyp abgekühlt.

Bestandteile der Ölphase:	(Gew.-%)
Verbindung II <sub>4</sub>	3,0
Stearinsäure	5,0
Cetostearylalkohol	1,0
Jojobaöl	15,0
Glycerinmonostearat	2,0
Propylenglycolmonolaurat	3,0

Bestandteile der Wasserphase:	
Propylenglycol	4,0
Triethanolamin	1,2
Methylparaben	0,3
Parfümgrundlage	0,1
gereinigtes Wasser	Ausgleich

Pulverförmige Bestandteile:	
Titanoxid	8,0
Talkum	4,0
Eisenoxid	0,5

#### Beispiel 8: Haartonikum

Ein Haartonikum wurde gemäß nachstehend beschriebener Zusammensetzung formuliert.

	(Gew.-%)
Verbindung II <sub>2</sub>	0,2
Menthol	0,2
Piloctonauramin (ein Antischuppenmittel)	0,1
Methylnicotinat	0,1
Ethanol	50,0
gereinigtes Wasser	Ausgleich

#### Beispiel 9:

Eine kosmetische Emulsion wurde in gleicher Weise wie in Beispiel 3 erhalten, mit der Abweichung, daß Verbindung II<sub>9</sub> anstelle von Verbindung II<sub>1</sub> verwendet wurde.

#### Beispiel 10:

Eine Reinigungscreme wurde in gleicher Weise wie in Beispiel 4 erhalten, mit der Abweichung, daß Verbindung II<sub>9</sub> anstelle von Verbindung II<sub>1</sub> verwendet wurde.

## Beispiel 11:

Ein Toilettenwasser wurde in gleicher Weise wie in Beispiel 5 erhalten, mit der Abweichung, daß Verbindung II<sub>10</sub> anstelle von Verbindung II<sub>2</sub> verwendet wurde.

## Beispiel 12:

Ein Lippenstift wurde in gleicher Weise wie in Beispiel 6 erhalten, mit der Abweichung, daß Verbindung II<sub>11</sub> anstelle von Verbindung II<sub>3</sub> verwendet wurde.

## Beispiel 13:

Eine Grundlage vom Emulsionstyp wurde in gleicher Weise wie in Beispiel 7 erhalten, mit der Abweichung, daß Verbindung II<sub>12</sub> anstelle von Verbindung II<sub>4</sub> verwendet wurde.

## Beispiel 14:

Ein Haartonikum wurde in gleicher Weise wie in Beispiel 8 erhalten, mit der Abweichung, daß Verbindung II<sub>10</sub> anstelle von Verbindung II<sub>2</sub> verwendet wurde.

## Beispiel 15: kosmetische Emulsion

Gemäß der vorstehend beschriebenen Zusammensetzung wurden die Komponenten der Ölphase vermischt, erwärmt und geschmolzen und bei 70°C gehalten. Die Komponenten der Wasserphase wurden ebenfalls vermischt, erwärmt und bei 70°C geschmolzen. Die vorstehend genannten Komponenten der Ölphase wurden zu den Komponenten der Wasserphase gegeben, gefolgt von Emulgation durch eine Emulgiervorrichtung. Eine so erhaltene Emulsion wurde auf eine Endtemperatur von 30°C mit einem Wärmetauscher unter Bereitstellung einer kosmetischen Emulsion herabgekühlt.

Bestandteile der Ölphase:	(Gew.-%)
Cetanol	0,5
Vaseline	3,0
Verbindung II <sub>5</sub>	5,0
Polyoxyethylen(10)monooleat	2,0
Stearinsäure	2,0
Bestandteile der Wasserphase:	
1,3-Butylenglycol	3,0
Dipropylenglycol	6,0
Triethanolamin	1,0
Ethylenparaben	0,1
Methylparaben	0,2
Parfümgrundlage	0,1
gereinigtes Wasser	Ausgleich

### Beispiel 16: Grundlage vom Emulsionstyp

Gemäß nachstehend beschriebener Zusammensetzung wurden die Bestandteile der Ölphase vermischt, erwärmt und geschmolzen und bei 70°C gehalten. Andererseits wurden pulverförmige Komponenten zugegeben und in den Komponenten der Wasserphase dispergiert. Die erhaltene Dispersion wurde auf 70°C erwärmt. Die vorstehenden Komponenten der Ölphase wurden zu den Komponenten der Wasserphase gegeben, gefolgt von Emulgation und Dispersion durch eine Emulgiervorrichtung. Eine so erhaltene Emulsion wurde auf eine Endtemperatur von 30°C mit einem Wärmetauscher gekühlt und dann in einen Behälter gefüllt, wodurch eine Grundlage vom Emulsionstyp erhalten wurde.

Bestandteile der Ölphase:	(Gew.-%)
Stearinsäure	5,0
Cetostearylalkohol	1,0
Olivenöl	15,0
Verbindung II <sub>5</sub>	3,0
Glycerinmonostearat	2,0
Propylenglycolmonolaurat	3,0
Bestandteile der Wasserphase:	
Propylenglycol	4,0
Triethanolamin	1,2
Ethylenparaben	0,1
Methylparaben	0,2
Parfümgrundlage	0,1
gereinigtes Wasser	Ausgleich
pulverförmige Komponenten:	
Titanoxid	8,0
Talkum	4,0
Eisenoxid	0,5

### Beispiel 17: Lippenstift

Gemäß nachstehend beschriebener Zusammensetzung wurde ein Lippenstift, durch Erwärmen und Schmelzen von mikrokristallinem Wachs, Candelillawachs, Rizinusöl, Verbindung II<sub>5</sub>, Jojobaöl, Olivenöl und Lanolin bei 90 bis 100°C, Zugabe des Pigments zu der Schmelze, Rühren des erhaltenen Gemisches zum Dispergieren des Pigments, Entlüften des so pigmentierten Gemisches, Zugabe der Parfümgrundlage zu dem so entlüfteten Gemisch, Gießen in eine Stiftform, Kühlen der Form auf 15 bis 20°C, anschließend Herausnahme des erhaltenen Lippenstiftes aus der Form, erhalten.

	(Gew.-%)
mikrokristallines Wachs	6,0
Candelillawachs	3,0
Rizinusöl	40,0
Verbindung II <sub>5</sub>	8,0
Jojobaöl	6,0
Lanolin	10,0
Olivenöl	Ausgleich
Pigment	7,0
Parfümgrundlage	0,1

#### Beispiel 18: Massagecreme vom W/O-Typ

Gemäß nachstehend beschriebener Zusammensetzung wurde Seifenpulver zu gereinigtem Wasser gegeben und das erhaltene Gemisch wurde erwärmt und bei 70°C gehalten. Die Komponenten der Ölphase wurden zugegeben und anschließend erwärmt und auf 70°C gehalten. Der vorstehend genannte Anteil der Wasserphase wurde zu dem Anteil der Ölphase gegeben, gefolgt von vorläufiger Emulgation. Das erhaltene Gemisch wurde anschließend gleichmäßig mit einem Homogenisator emulgiert, gefolgt von Kühlen auf Raumtemperatur oder dergleichen mit einem Wärmetauscher.

Bestandteile der Ölphase:	(Gew.-%)
Paraffin	4,0
mikrokristallines Wachs	6,0
Bienenwachs	6,0
Vaseline	10,0
Verbindung II <sub>8</sub>	4,0
flüssiges Paraffin	40,0
Sorbitansesquioleat	3,5
Polyoxyethylensorbitanmonooleat (20 EO)	0,5
Bestandteile der Wasserphase:	
Ethylenparaben	0,1
Methylparaben	0,2
Tocopherylacetat	0,5
Seifenpulver	0,3
gereinigtes Wasser	Ausgleich

#### Beispiel 19: Packung (Abziehtyp)

Gemäß nachstehend beschriebener Zusammensetzung wurden Komponenten der Wasserphase vermischt, erwärmt und geschmolzen und bei 70°C gehalten. In ähnlicher Weise wurden die Komponenten der Ölphase erwärmt und bei 70°C vermischt. Die Komponenten der Ölphase wurden zu den vorstehend

genannten Komponenten der Wasserphase gegeben und das erhaltene Gemisch wurde mit einer Emulgier-  
vorrichtung emulgiert. Die pulverförmigen Bestandteile und das filmbildende Mittel wurden zugegeben  
und mit der Emulsion vermischt. Die erhaltene Emulsion wurde auf eine Endtemperatur von 30°C mit ei-  
nem Wärmetauscher abgekühlt und anschließend in einen Behälter gefüllt, wodurch eine Packung erhalten  
wurde.

Ölphasenkomponenten:	(Gew.-%)
Squalan	2,0
Verbindung II <sub>6</sub>	1,0
hydrophobes Glycerinmonostearat	
Polyoxyethylensorbitanmonolaurat (20 EO)	1,0
Bestandteile der Wasserphase:	
Glycerin	3,0
Propylenglycol	3,0
Veegum	1,0
gereinigtes Wasser	Ausgleich
Ethanol	7,0
pulverförmige Komponenten:	
Titanoxid	10,0
Kaolin	3,0
filmbildendes Mittel:	
Polyvinylalkohol	10,0
Parfümgrundlage	0,5
Antiseptikum	0,1

#### Beispiel 20: Haartonikum

Die nachstehenden Bestandteile wurden erwärmt und bei 70°C gelöst und anschließend unter  
Bereitstellung eines Haartonikums gekühlt.

	(Gew.-%)
Verbindung II <sub>7</sub>	0,2
Menthol	0,2
Piloctonauramin (Antischuppenmittel)	0,1
Methylnicotinat	0,1
Ethanol	45,0
gereinigtes Wasser	Ausgleich

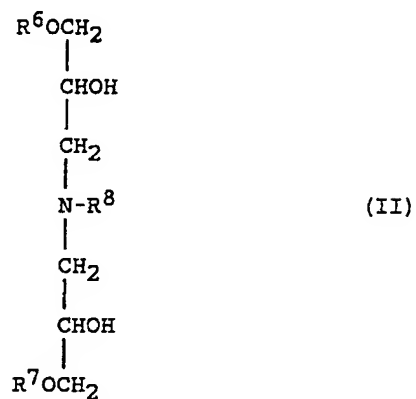
Alle in den Beispielen 3 bis 20 erhaltenen äußeren Zubereitungen zur Hautpflege waren zur  
Verbesserung der Haut in bezug auf Rauigkeit stark wirksam und zeigten ein überlegenes Befeuchtungs-  
vermögen.



92 115 766.5

Patentanspruch

1. Äußere Zubereitung zur Hautpflege, umfassend eine Verbindung, wiedergegeben durch die nachstehende allgemeine Formel (II) oder ein Salz davon:

Allgemeine Formel (II):

worin  $\text{R}^6$  und  $\text{R}^7$  einzeln eine aliphatische Kohlenwasserstoffgruppe mit 10 bis 26 Kohlenstoffatomen bedeuten und  $\text{R}^8$  eine Gruppe  $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ ,  $-\text{CH}_2\text{COOH}$  oder  $-\text{COCH}_3$  wiedergibt und außerdem umfassend ein Tensid.

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

**BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☒ **BLACK BORDERS**
- ☒ **IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- ☐ **FADED TEXT OR DRAWING**
- ☐ **BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- ☐ **SKEWED/SLANTED IMAGES**
- ☐ **COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- ☒ **GRAY SCALE DOCUMENTS**
- ☒ **LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- ☒ **REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- ☐ **OTHER: \_\_\_\_\_**

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**